

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN(11)Publication number : **2001-316226**(43)Date of publication of application : **13.11.2001**

(51)Int.Cl.

**A61K 7/06
A61K 31/095
A61P 17/00
A61P 43/00**(21)Application number : **2000-132482**(71)Applicant : **NONOGAWA SHOJI KK**(22)Date of filing : **01.05.2000**(72)Inventor : **KATO MIYUKI
SAWADA HITOSHI
KISHI MASATAKA
MIYAMOTO KUNIHIRO
NAKADA SATORU****(54) HAIR COSMETIC**

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a hair cosmetic comprising a tyrosinase activity promoting composition or gray hair preventive composition used safely and having an excellent effect in practical use.

SOLUTION: This hair cosmetic comprising a tyrosinase activity promoting composition or gray hair preventive composition is characterized by containing dithiooctanediol as active ingredient.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the
examiner's decision of rejection or application
converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of
rejection][Date of requesting appeal against examiner's decision
of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2001-316226

(P 2 0 0 1 - 3 1 6 2 2 6 A)

(43) 公開日 平成13年11月13日 (2001.11.13)

(51) Int. Cl. ⁷	識別記号	F I	テーマコード (参考)
A61K 7/06		A61K 7/06	4C083
31/095		31/095	4C206
A61P 17/00		A61P 17/00	
43/00	111	43/00	111

審査請求 未請求 請求項の数 3 O L (全 6 頁)

(21) 出願番号	特願2000-132482 (P 2000-132482)	(71) 出願人	000249908 有限会社野々川商事 愛知県名古屋市中区丸の内3丁目5番24号
(22) 出願日	平成12年5月1日 (2000.5.1)	(72) 発明者	加藤 美由紀 愛知県名古屋市中区鳥見町2-7 日本メ ナード化粧品株式会社総合研究所内
		(72) 発明者	澤田 均 愛知県名古屋市中区鳥見町2-7 日本メ ナード化粧品株式会社総合研究所内
		(72) 発明者	岸 正孝 愛知県名古屋市中区鳥見町2-7 日本メ ナード化粧品株式会社総合研究所内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 頭髮化粧料

(57) 【要約】

【課題】安全で、実使用において優れた効果を示すチロシナーゼ活性促進用組成物、白髪防止用組成物を提供すること。

【解決手段】ジチオオクタンジオールを有効成分として含有することを特徴とするチロシナーゼ活性促進用組成物、白髪防止用組成物である。

【特許請求の範囲】

【請求項1】ジチオオクタンジオールを有効成分として含有することを特徴とする頭部用化粧料。

【請求項2】ジチオオクタンジオールの配合量が0.01～50mg/mlであることを特徴とする請求項第1項の頭部用化粧料。

【請求項3】ジチオオクタンジオールの配合量が0.5～30mg/mlであることを特徴とする請求項第1項の頭部用化粧料。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、ジチオオクタンジオールを有効成分とするチロシナーゼ活性促進作用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術及び発明が解決しようとする課題】白髪防止用組成物としては、白髪の発生機序または、逆にメラニン色素形成機序等を参考に有効物質をスクリーニングするか、或いは無作為に各種物質の白髪防止作用を検討することによって得られた多種多様な化合物（または物質）の使用が提案されている。

【0003】例えば、メラノサイトの cyclic AMP 産生能の向上を図るもの（特開平4-124122号公報参照）、メラノサイトのメラニン生成の活性化を図るもの（例えば、特開平5-78222号、特開平7-285874号、特開平7-316026号公報等参照）、その他育毛効果と白髪防止効果の両効果を奏すると称されるもの（特開平7-112918号、特開平7-126129号公報等参照）が挙げられる。これらには、動植物からの抽出物を有効成分とするものが殆どであり、一定の目的を達成できるとの記述が認められる。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】しかしながら、白髪の発生機序の複雑さを考慮し、他方、天然産物の多様性に着目すると、より安定かつ安全性の高い新規の白髪防止組成物の提供が望まれる。

【0005】したがって、本発明の目的は、従来白髪防止用に使用されていないが、実使用において優れた効果を示す白髪防止用組成物を提供することにある。

【0006】

【課題を解決するための手段】上記課題を解決するために本発明者らは、白髪の発生機序およびその各段階における各種化合物または物質の作用効果について基礎研究を行うとともに、実使用において有効性について検討を重ねてきた。その結果、ジチオオクタンジオールが、優れたチロシナーゼ活性促進作用とともに白髪防止（または白髪の黒化）作用を示すことを見出した。

【0007】ジチオオクタンジオールは融点が63～64℃の粉体であり、水に可溶性性質をもつ直鎖状の物質である。

【0008】

【発明の実施の形態】すなわち、本発明はジチオオクタンジオールを有効成分として含有することを特徴とする液状組成物を提供するものである。

【0009】また、本発明は、ジチオオクタンジオールを有効成分として含んでなるチロシナーゼ活性促進作用組成物または白髪防止用組成物であって、有効成分が、ジチオオクタンジオールからなる各組成物を提供するものである。

10 【0010】なお、本発明において、「白髪防止」とは「白髪の黒化作用」の概念も包含する。そして、白髪の防止効果は、頭髮に直接な作用機序を示す場合と頭部における経皮的な作用機序を示す場合の両方を含む。

【0011】このような組成物は、毛髪用組成物または皮膚外用組成物（化粧料または薬剤）に常用されている希釈剤、アニオン性界面活性剤、非イオン性界面活性剤、カチオン性界面活性剤、両性界面活性剤、高級アルコール、油分、保湿剤、増粘剤、溶剤、使用性向上剤、防腐剤、酸化防止剤、金属イオン封鎖剤、紫外線防止剤、粉末、その他の活性物質、色剤、香料等を目的とする剤形に応じて適宜使用して製剤化することができる。本発明で使用する上記添加物は、必ずしも単一の機能によって分離できるものではないが、以下、通常分類されている例に従って説明する。

【0012】希釈剤としては、例えば、水、エタノール、イソプロピルアルコール、グリコール類が挙げられる。アニオン性界面活性剤としては、例えば、アルキルベンゼンスルホン酸塩、ポリオキシアルキレンアルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸エステル塩、スルホン酸塩、アルキルりん酸塩、ポリオキシアルキレンアルキルりん酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩および脂肪酸塩等が挙げられる。非イオン性界面活性剤としては、例えば、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、多価アルコール脂肪酸部分エステル、ポリオキシエチレン多価アルコール脂肪酸部分エステル、ポリグリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油誘導体および脂肪酸等が挙げられる。

【0013】カチオン性界面活性剤としては、例えば、第3級脂肪族アミン類、アルキルトリメチルアンモニウムハイドライド、ジアルキルジメチルアンモニウムハイドライドおよびアルキルジメチルベンジルアンモニウムハイドライド等が挙げられる。両性界面活性剤としては、例えば、アミドベタイン型、イミダゾリニウムベタイン型およびスルホベタイン型等の界面活性剤が挙げられる。

【0014】高級アルコールとしては、例えば、セチルアルコール、ステアリルアルコール、ベヘニルアルコール等がある。

50 【0015】油分としては、例えば、高級脂肪酸、固形

パラフィン、シリコン油、高分子シリコンおよびその誘導体、スクワラン、ワセリン、ならびにエステル油等が挙げられる。

【0016】保湿剤としては、例えば、グリセリン、プロピレングリコール、1, 3-ブチレングリコール、ジプロピレングリコールおよびソルビトール等が挙げられる。

【0017】増粘剤としては、例えば、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、カラギーナン、カルボキシメチルセルロースおよびカチオン化セルロース等が挙げられる。

【0018】粉末としては、例えば、シリカ、ナイロンパウダーおよびポリエチレンパウダー等の樹脂粉末等が挙げられる。

【0019】本発明の頭部用組成物、チロシナーゼ活性促進用組成物、白髪防止用組成物（本明細書においては、単に、組成物という場合がある）には、発明の效果に悪影響を及ぼさない限り、養毛料の成分として用いることができるいかなる成分を含めてもよい。

【0020】このような成分には、それ自体発毛効果等を有することが示唆されている活性成分や助剤が含まれる。例えば、センブリエキス、ニンジン抽出液等の植物抽出エキス、ビタミンB₆、ビタミンEおよびその誘導体、ピオチン等のビタミン類、パントテン酸およびその誘導体、グリチルリチン酸およびその誘導体、ニコチン酸エステル、セリン、メチオニン等のアミノ酸類、セフォランチン、塩化カプロニウム、ミノキシジル、ニコランジル、アセチルコリン誘導体、サイクロスポリン類、およびエストラジオール等の女性ホルモン剤等、ならびにこれらの混合物が挙げられる。

【0021】さらに、例えば、ヒノキチオール、ヘキサクロロフェン、ベンザルコニウムクロリド、セチルピリジニウムクロリド、ウンデシレン酸、トリクロロカルバニリドおよびピチオノール等の抗菌剤、メントール等の清涼剤、サリチル酸、亜鉛およびその誘導体、乳酸およびそのアルキルエステル等の活性物質、クエン酸等の有機酸類、アルギニン等のアミノ酸類も、本発明の組成物に添加することができる。

【0022】これらの製品形態をとる組成物中に含まれるジチオオクタンジオールは、形態に応じて異なるので特定することはできないが、一般に、総組成物重量あたり、0.01~50mg/ml、好ましくは0.5~30mg/mlである。0.01mg/ml未満の場合には、本発明の目的を十分に達成できないことが

ある。また、50mg/ml以上では製剤上また経済上において好ましくないことがある。

【0023】本発明の頭部用組成物は、頭皮ないし頭髮に使用するものを広く指し、例えば、シャンプー、リンス、ヘヤーニック、ヘヤーコンデショナー、スカルプトリートメント等の養毛料、ヘヤーリキッド、ヘヤースプレー、ヘヤークリーム等の整髪料等が含まれる。

【0024】本発明の組成物の形態は、液状、乳液、軟膏などの皮膚または頭皮に適用できる性状のものであればいずれでもよく、一般的に、例えば、エモリエントローション、エモリエントクリーム、モイスチャージェル、ヘヤーローション、ヘヤーニック、ヘヤーリキッド、スカルプトリートメント、ヘヤークリーム、エアゾールフォーム、エアゾールスプレー、ヘヤージェル、スプレーフォーム等と称される製品形態をとることができる。

【0025】なお、本明細書において、頭部用組成物とは白髪防止用組成物を包括し、この上位概念を表す。また、チロシナーゼ活性促進用は白髪防止用組成物等の頭部用組成物として使用される。

【0026】

【発明の効果】次に、本発明の效果を実験により明らかにする。ただし、本発明の技術的範囲はこれによってなんら限定されるものではない。なお、配合量はすべて重量%である。

【0027】I. 効果確認試験

ジチオオクタンジオールを精製水に10%溶解希釈して、この溶液を用いて濃度を調節し、得られた希釈液を使用して次の実験を行った。

30 【0028】(1) 細胞培養法

マウス由来のB16メラノーマ培養細胞を使用した。対数増殖期にあるメラノーマをφ60mm dishに 2×10^4 細胞播種し、最終濃度0.01~1mg/mlになるようにジチオオクタンジオールを含むEagles' MEM (10%FCSを含む)を加え、37℃、5%CO₂条件下にて培養した。培養5日後に細胞をdishから剥離し、細胞を超音波破碎した後に、2N NaOHを加え、60℃で2時間の処理を行い、分光光度計で0.D.475nmを測定した。なお、超音波破碎後の細胞破碎液をLowryの方法(J. Biol. Chem., 193, 265-275, 1951)でタンパク定量し、タンパク量当りのメラニン量を比較することによって、メラニン生成抑制効果の指標とした。結果を表1に示す。

【0029】

【表1】

試料	試料濃度 (mg/ml)	メラニン量 (μ g/mg 蛋白)	チロシナーゼ促進率 (%)
Control		34.1 \pm 1.0	
ジチオオクタンジオール	0.01	33.9 \pm 0.3	-0.5
	0.03	34.4 \pm 0.6	0.9
	0.1	36.5 \pm 0.5	7.1
	0.3	37.7 \pm 0.4	10.6
	0.5	42.6 \pm 0.3	24.9
	1.0	52.4 \pm 0.4	53.9

【0030】(2) 累積塗布による白髪防止効果

被験者として、各試料ごとに白髪のある40～60歳の男女36名に1日2回(朝、夜)連続20週間、ジチオオクタンジオールを用いた下記組成からなる本発明ローションと、本発明ローションからジチオオクタンジオールを除いたもの(対照ローション)をそれぞれハーフヘッド法で左右頭皮に別々に使用してもらい、塗布部位の状態を試験前後で比較し、白髪防止・改善効果を下記試験方法、判定基準を用い、評価した。

【0031】(使用したローション)

本発明ローション

配 合 成 分	配 合 量
(1) グリセリン	2.0
(2) L-メントール	0.1
(3) ジチオオクタンジオール	0.1
(4) エチルアルコール	60.0
(5) 防腐剤	適量
(6) 香料	適量
(7) 精製水	残余

(調製法) (4)に(5)、(6)を加えて均一に溶解する。これに、あらかじめ溶解させておいた水相部(1)、(2)、(3)、(7))を添加し、溶解する。

【0032】対照ローション上記において、(3)を除いた以外は、本発明ローションと同様にして調整した。

(試験方法) 本発明ローションと対照ローションを、上記のようにそれぞれハーフヘッド法で左右頭皮に別々に20週間、毎日2回(朝、夜)塗布、使用してもらい、塗布開始前および塗布開始後20週における頭頂部の毛髪1,000本あたりの白髪の本数を数えた。

<判定基準>

++ (著効) : 塗布開始前の白髪の本数に対して塗布後の白髪の本数が80%未満の被験者が半数(18名)以

上

+ (著効) : 塗布開始前の白髪の本数に対して塗布後の白髪の本数が80%以上90%未満の被験者が半数(18名)以上

± (やや有効) : 塗布開始前の白髪の本数に対して塗布後の白髪の本数が90%以上100%未満の被験者が半数(18名)以上

- (無効) : 塗布開始前の白髪の本数に対して塗布後の白髪の本数が90%以上100%未満の被験者が半数(18名)未満

結果を表2に示す。

【0033】

【表2】

試験物質	白髪防止効果
対照ローション	-
本発明ローション	+

【0034】

【実施例】II. 実施例(製剤例)

(実施例1) スカルプヘヤトニック

配 合 成 分	配 合 量
(1) リン酸L-アスコルビンマグネシウム	1.0
(2) エデト酸四ナトリウム	0.05
(3) ジチオオクタンジオール	0.5
(4) クエン酸ナトリウム	0.3
(5) エタノール	70.0
(6) 硬化ヒマシ油EO(50モル)付加物	0.5
(7) 防腐剤	0.1
(8) メントール	0.1
(9) 香料	適量
(10) 精製水	残余
(調製法) (1)～(4)および(10)を45～50	

て、(5)～(8)を30～40℃でそれぞれ溶解または混和する。攪拌溶解した後、これらをあわせてよく攪拌し、(9)を加えて、標題の組成物(製品)を得た。

【0035】(実施例2)ヘヤトニック

配 合 成 分	配 合 量
(1) グリセリン	2.0
(2) メントール	0.1
(3) ジチオオクタジオール	0.5
(4) エタノール	65.0
(5) 香料	適量
(6) 精製水	残余
(調製法) (4)に(1)、(2)、(3)、(5)を加えて、攪拌溶解した後、(6)を加えて均一に混和し、標題の組成物(製品)を得た。	

【0036】(実施例3)ヘヤリキッド

配 合 成 分	配 合 量
(1) 硬化ヒマシ油EO(20モル)付加物	1.6
(2) N-メタクリロイルオキシエチル N,N-ジメチルアンモニウム α-メチルカルボキシベタイン・ メタクリル酸ブチル共重合体	3.0
(3) ジチオオクタジオール	1.0
(4) グリセリン	5.0
(5) エタノール	40.0
(6) 精製水	残余
(調製法) (1)～(4)を常温で混合し、均一に溶解する。攪拌溶解した後、これらに(6)を加えてよく攪拌し、標題の組成物(製品)を得た。	

【0037】

(実施例4)ヘヤリキッド

配 合 成 分	配 合 量
(1) ポリオキシプロピレンブチルエーテル	20.0
(2) エタノール	50.0
(3) ジチオオクタジオール	1.0
(4) 香料	適量
(5) エデト酸塩	適量
(6) 色素	適量
(7) 精製水	残余
(調製法) (1)～(4)、(5)～(7)をそれぞれ	

常温で混合し、均一に溶解する。攪拌溶解した後、二相をあわせ、よく攪拌し、標題の組成物(製品)を得た。

【0038】(実施例5)ヘヤリンス

配 合 成 分	配 合 量
(1) 塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	4.0
(2) モノステアリン酸グリセリル	1.0
(3) セタノール	2.5
(4) オクチルドデカノール	2.0
(5) プロピレングリコール	5.0
(6) 防腐剤	適量
(7) ジチオオクタジオール	2.0
(8) 精製水	残余
(調製法) (1)～(6)、(7)～(8)をそれぞれ80℃に加熱して均一に溶解する。(7)～(8)を(1)～(6)を徐々に加えて乳化する。攪拌を続けて40～35℃で攪拌を止め、標題の組成物(製品)を得た。	

【0039】(実施例6)ヘヤリンス

配 合 成 分	配 合 量
(1) ステアリン酸ジエチルアミノエチルアミド	3.0
(2) リン酸	0.8
(3) セタノール	4.0
(4) トリ2-エチルヘキサン酸グリセリル	2.0
(5) 1,3-ブチレングリコール	3.0
(6) 防腐剤	適量
(7) ジチオオクタジオール	3.0
(8) 精製水	残余
(調製法) (1)～(6)、(7)～(8)をそれぞれ80℃に加熱して均一に溶解する。(7)～(8)を(1)～(6)を徐々に加えて乳化する。攪拌を続けて40～35℃で攪拌を止め、標題の組成物(製品)を得た。	

【0040】実施例1～6においても、実使用検討の結果、良好な白髪防止効果、改善効果を得た。

【0041】以上詳述したように本発明によれば、チロシナーゼ活性促進作用および白髪防止用に優れた組成物が提供される。

フロントページの続き

- (72)発明者 宮本 國寛
愛知県名古屋市区鳥見町2-7 日本メ
ナード化粧品株式会社総合研究所内
- (72)発明者 中田 悟
愛知県名古屋市区鳥見町2-7 日本メ
ナード化粧品株式会社総合研究所内

Fターム(参考) 4C083 AA122 AC072 AC102 AC122
AC182 AC302 AC422 AC532
AC692 AC761 AC762 AC902
AD132 AD532 AD642 CC31
CC33 CC39 DD23 DD27 EE24
4C206 AA01 AA02 JA61 MA01 MA04
MA37 MA83 NA14 ZA92 ZC19